

Document made available under the Patent Cooperation Treaty (PCT)

International application number: PCT/EP05/002424

International filing date: 08 March 2005 (08.03.2005)

Document type: Certified copy of priority document

Document details: Country/Office: DE
Number: 102004012019.6
Filing date: 10 March 2004 (10.03.2004)

Date of receipt at the International Bureau: 20 April 2005 (20.04.2005)

Remark: Priority document submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b)



World Intellectual Property Organization (WIPO) - Geneva, Switzerland
Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle (OMPI) - Genève, Suisse

55486
PCT/EP2005/00242

BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND

EP05/2424



Prioritätsbescheinigung über die Einreichung einer Patentanmeldung

Aktenzeichen:

10 2004 012 019.6

Anmeldetag:

10. März 2004

Anmelder/Inhaber:

BASF Aktiengesellschaft, 67063 Ludwigshafen/DE

Bezeichnung:

5,6-Dialkyl-7-amino-triazolopyrimidine, Verfahren zu
ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur
Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende
Mittel

IPC:

C 07 D, A 01 N

Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ur-
sprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.

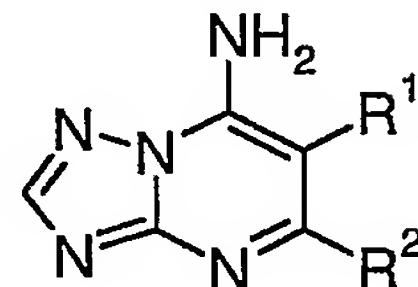
München, den 23. Februar 2005
Deutsches Patent- und Markenamt
Der Präsident
Im Auftrag

Wehner

Wehner

Patentansprüche

1. Triazolopyrimidine der Formel I



I

5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

R¹ C₁-C₁₄-Halogenalkyl, C₁-C₁₂-Halogenalkoxy-C₁-C₁₂-alkyl, C₁-C₁₂-Alkoxy-C₁-C₁₂-halogenalkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl, C₂-C₁₂-Halogenalkenyl, C₂-C₁₂-Alkinyl oder C₂-C₁₂-Halogenalkinyl, wobei die Kohlenstoffketten eine bis drei Gruppen R^a tragen können:

10 R^a Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₁₂-Alkenyloxy, C₃-C₁₂-Alkinyloxy, NR¹¹R¹², oder

15 C₃-C₆-Cycloalkyl, welches eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen C₁-C₄-Alkyl, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy, NR¹¹R¹² tragen kann;

20 R¹¹, R¹² Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

25 wobei die Kohlenstoffketten der Gruppen R^a ihrerseits halogeniert sein können;

R² C₁-C₁₂-Alkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl oder C₂-C₁₂-Alkinyl, wobei die Kohlenstoffketten durch eine bis drei Gruppen R^b substituiert sein können:

30 R^b Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₁₂-Alkenyloxy, C₃-C₁₂-Alkinyloxy, NR¹¹R¹²; oder C₃-C₆-Cycloalkyl, welches eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen C₁-C₄-Alkyl, Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy oder NR¹¹R¹² tragen kann.

35 2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, worin R¹ und R² gemeinsam nicht mehr als 14 Kohlenstoffatome aufweisen.

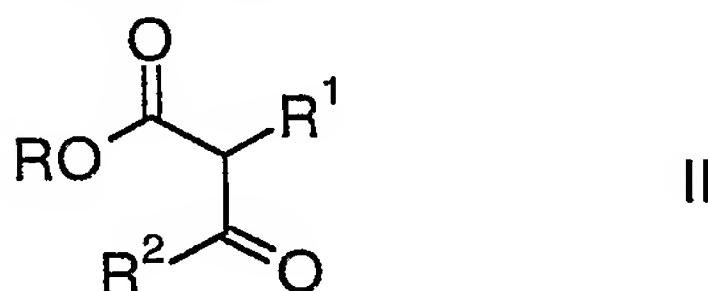
3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, worin R¹ für Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-

2

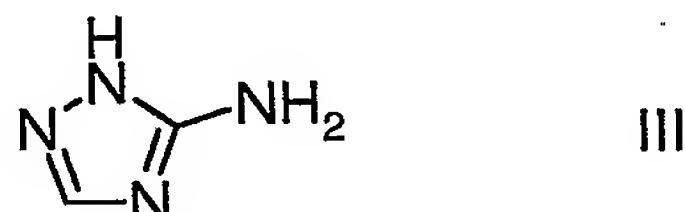
fluoreethyl, 2-Chlor-2,2-difluoreethyl, 2,2-Dichlor-2-fluoreethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluoreethyl, 1,1,1-Trifluorprop-2-yl, 1-Chlorpropyl, 1-Fluorpropyl, 3-Chlorpropyl, 3-Fluorpropyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, 1-Chlorbutyl, 1-Fluorbutyl, 4-Chlorbutyl, 4-Fluorbutyl, 4,4,4-Trifluorbutyl, 1-Chlorpentyl, 1-Fluorpentyl, 5,5,5-Trifluorpentyl, 5-Chlorpentyl, 5-Fluorpentyl, 1-Chlorhexyl, 1-Fluorhexyl, 6-Chlorhexyl, 6-Fluorhexyl, 6,6,6-Trifluorhexyl, 1-Chlorheptyl, 1-Fluorheptyl, 7-Chlorheptyl, 7-Fluorheptyl, 7,7,7-Trifluorheptyl, 1-Chloroctyl, 1-Fluoroctyl, 8-Fluoroctyl, 8,8,8-Trifluoroctyl, 1-Chlornonyl, 1-Fluornonyl, 9-Fluornonyl, 9,9,9-Trifluornonyl, 9-Chlornonyl, 1-Fluordecyl, 1-Chlordecyl, 10-Fluordecyl, 10,10,10-Trifluordecyl, 10-Chlordecyl, 1-Chlorundecyl, 1-Fluorundecyl, 11-Chlorundecyl, 11-Fluorundecyl, 11,11,11-Trifluorundecyl, 1-Chlordodecyl, 1-Fluordodecyl, 12-Chlordodecyl, 12-Fluordodecyl oder 12,12,12-Trifluordodecyl steht.

4. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, worin R² für Methyl, Ethyl, iso-Propyl, n-Propyl oder n-Butyl steht.

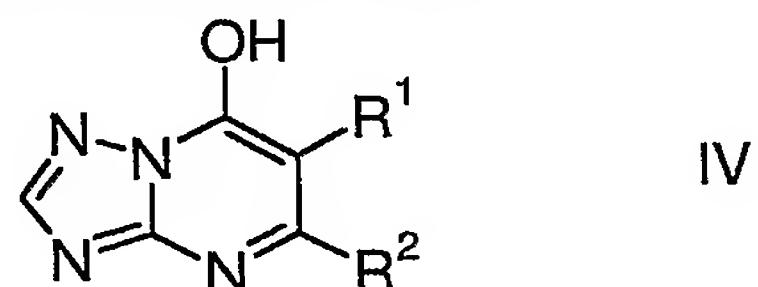
5. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man β -Ketoester der Formel II,



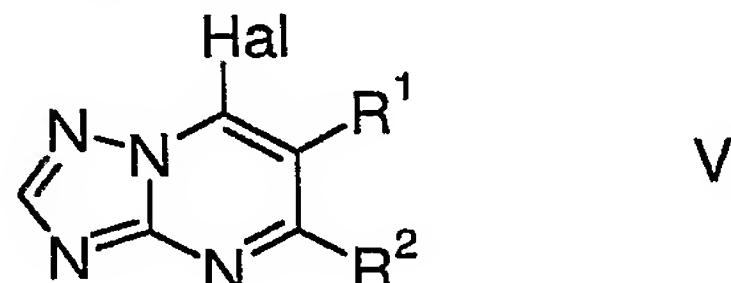
20 in der R für C₁-C₄-Alkyl steht, mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III



zu 7-Hydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV



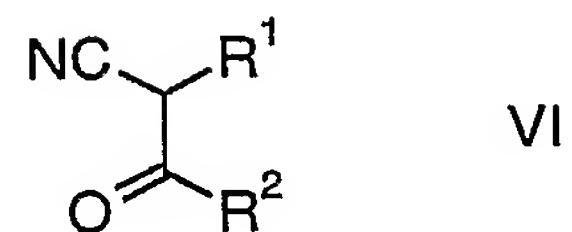
umsetzt, welche zu Verbindungen der Formel V,



25 in der Hal für Chlor oder Brom steht, halogeniert werden, und V mit Ammoniak umgesetzt wird.

30 6. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man Acylcyanide der Formel VI,

3



mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III gemäß Anspruch 5 umsetzt.

7. Fungizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Träger und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1

5

8. Saatgut, enthaltend 1 bis 1000 g einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 pro 100 kg.

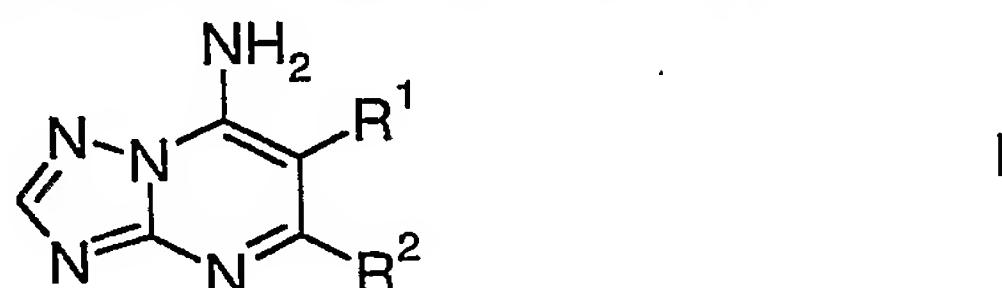
10 9. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

5,6-Dialkyl-7-amino-triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft 5,6-Dialkyl-7-amino-triazolopyrimidine der Formel I



in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

10 R¹ C₁-C₁₄-Halogenalkyl, C₁-C₁₂-Halogenalkoxy-C₁-C₁₂-alkyl, C₁-C₁₂-Alkoxy-C₁-C₁₂-halogenalkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl, C₂-C₁₂-Halogenalkenyl, C₂-C₁₂-Alkinyl oder C₂-C₁₂-Halogenalkinyl, wobei die Kohlenstoffketten eine bis drei Gruppen R^a tragen können:

15 R^a Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₁₂-Alkenyloxy, C₃-C₁₂-Alkinyloxy, NR¹¹R¹², oder

20 C₃-C₆-Cycloalkyl, welches eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen C₁-C₄-Alkyl, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy, NR¹¹R¹² tragen kann;

25 R¹¹, R¹² Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

25 wobei die Kohlenstoffketten der Gruppen R^a ihrerseits halogeniert sein können;

30 R² C₁-C₁₂-Alkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl oder C₂-C₁₂-Alkinyl, wobei die Kohlenstoffketten durch eine bis drei Gruppen R^b substituiert sein können:

35 R^b Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₁₂-Alkenyloxy, C₃-C₁₂-Alkinyloxy, NR¹¹R¹²; oder C₃-C₆-Cycloalkyl, welches eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen C₁-C₄-Alkyl, Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy, NR¹¹R¹² tragen kann.

35 Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

In GB 1 148 629 werden 5,6-Dialkyl-7-amino-triazolopyrimidine allgemein vorgeschlagen. Aus EP-A 141 317 sind einzelne fungizid wirksame 5,6-Dialkyl-7-amino-triazolopyrimidine bekannt. Ihre Wirkung ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend.

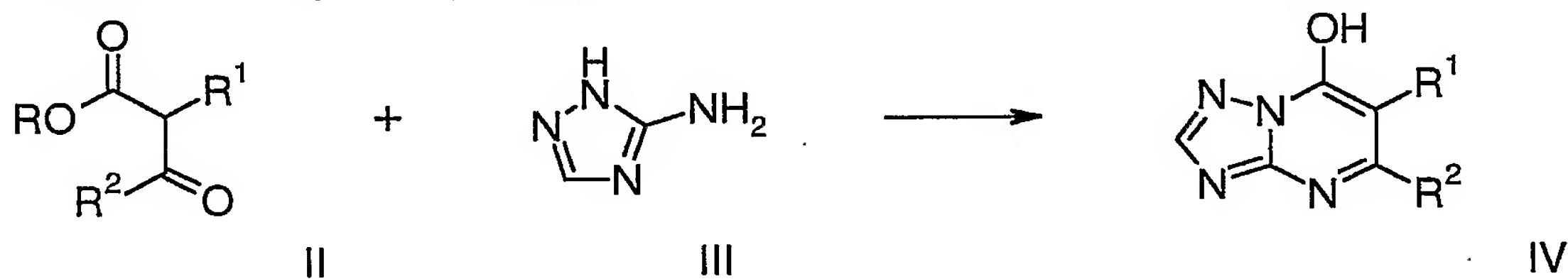
5 Davon ausgehend, liegt der vorliegenden Erfindung die Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirkung und/oder verbreitertem Wirkungsspektrum bereitzustellen.

Demgemäß wurden die eingangs definierten Verbindungen gefunden. Des weiteren wurden Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel 10 sowie Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen unter Verwendung der Verbindungen I gefunden.

15 Die Verbindungen der Formel I unterscheiden sich von den aus den oben genannten Schriften durch die spezielle Ausgestaltung des Substituenten in der 6-Position des Triazolopyrimidin-Gerüstes, der eine Halogenalkylgruppe oder eine ungesättigte aliphatische Gruppe darstellt.

20 Die Verbindungen der Formel I weisen eine gegenüber den bekannten Verbindungen erhöhte Wirksamkeit gegen Schadpilze auf.

25 Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auf verschiedenen Wegen erhalten werden. Vorteilhaft werden die erfindungsgemäßen Verbindungen erhalten, indem man substituierte β -Ketoestern der Formel II mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III zu 7-Hydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV umsetzt. Die Gruppen R¹ und R² in Formeln II und IV haben die Bedeutungen wie für Formel I und die Gruppe R in Formel II bedeutet C₁-C₄-Alkyl, aus praktischen Gründen ist Methyl oder Ethyl darin bevorzugt.



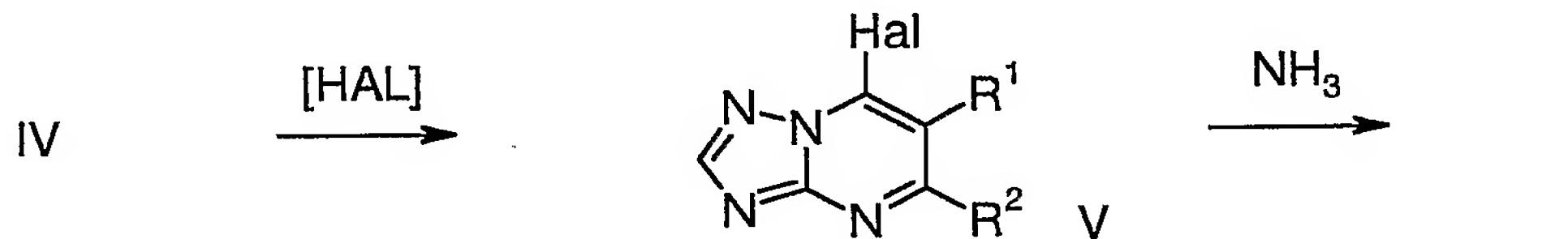
30 Die Umsetzung der substituierten β -Ketoester der Formel II mit den Aminozolen der Formel III kann in Gegenwart oder Abwesenheit von Lösungsmitteln durchgeführt werden. Vorteilhaft ist es, solche Lösungsmittel zu verwenden, gegenüber denen die Einsatzstoffe weitgehend inert sind und in denen sie ganz oder teilweise löslich sind. Als Lösungsmittel kommen insbesondere Alkohole wie Ethanol, Propanole, Butanole, Glykole oder Glykolmonoether, Diethylenglykole oder deren Monoether, Amide wie Dimethylformamid, Diethylformamid, Dibutylformamid, N,N-Dimethylacetamid, niedere 35 Alkansäuren wie Ameisensäure, Essigsäure, Propionsäure oder Basen, wie wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride, Alkalimetallamide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate sowie Alkalimetallhydrogencarbonate, metallorganische Verbindungen, insbe-

sondere Alkalimetallalkyle, Alkylmagnesiumhalogenide sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate und Dimethoxymagnesium, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Tri-isopropylethylamin, Tributylamin und N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin,

5 Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine und Mischungen dieser Lösungsmittel mit Wasser in Frage. Besonders bevorzugt wird die Umsetzung ohne Lösungsmittel oder in Chlorbenzol, Xylol, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon durchgeführt. Besonders bevorzugte Basen sind tertiäre Amine wie Tri-isopropylethylamin, Tributylamin, N-Methylmorpholin oder N-Methylpiperidin. Die Temperaturen liegen zwischen 50 und 300°C, vorzugsweise bei 50 bis 150°C, wenn in Lösung gearbeitet wird [vgl. EP-A 770 615; Adv. Het. Chem. Bd. 57, S. 81ff. (1993)].

10

Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuss oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

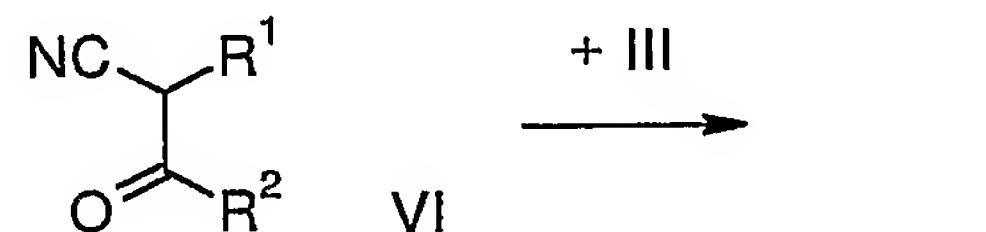


Die so erhaltenen Kondensationsprodukte der Formel IV fallen aus den Reaktionslösungen meist in reiner Form aus und werden nach dem Waschen mit dem gleichen Lösungsmittel oder mit Wasser und anschließendem Trocknen mit Halogenierungsmitteln, insbesondere Chlorierungs- oder Bromierungsmittel zu den Verbindungen der Formel V, in der Hal für Chlor oder Brom, insbesondere für Chlor steht, umgesetzt. Bevorzugt erfolgt die Umsetzung mit Chlorierungsmitteln, wie Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid oder Sulfurylchlorid bei 50°C bis 150°C vorzugsweise in überschüssigem Phosphoroxitrichlorid bei Rückflußtemperatur. Nach dem Verdampfen des überschüssigen Phosphoroxitrichlorids wird der Rückstand mit Eiswasser gegebenenfalls unter Zusatz eines mit Wasser nicht mischbaren Lösungsmittels behandelt. Das aus der getrockneten organischen Phase gegebenenfalls nach Verdampfung des inerten Lösungsmittels isolierte Chlorierungsprodukt ist meist sehr rein und wird anschließend mit Ammoniak in inertem Lösungsmittel bei 100°C bis 200°C zu den 7-Amino-triazolo[1,5-a]-pyrimidinen umgesetzt. Die Reaktion wird vorzugsweise mit 1- bis 10-molarem Überschuss an Ammoniak unter Druck von 1 bis 100 bar durchgeführt.

30 Die neuen 7-Amino-azolo[1,5-a]-pyrimidine werden gegebenenfalls nach Verdampfen des Lösungsmittels durch Digerieren in Wasser als kristalline Verbindungen isoliert.

35 Die β -Ketoester der Formel II können hergestellt werden wie in Organic Synthesis Coll. Vol. 1, S. 248 beschrieben, bzw. sind kommerziell erhältlich.

Alternativ können die neuen Verbindungen der Formel I erhalten werden, indem man substituierte Acylcyanide der Formel VI, in der R¹ und R² die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III umsetzt.



5 Die Umsetzung kann in Gegenwart oder Abwesenheit von Lösungsmitteln durchgeführt werden. Vorteilhaft ist es, solche Lösungsmittel zu verwenden, gegenüber denen die Einsatzstoffe weitgehend inert sind und in denen sie ganz oder teilweise löslich sind. Als Lösungsmittel kommen insbesondere Alkohole wie Ethanol, Propanole, Butanole, Glykole oder Glykolmonoether, Diethylenglykole oder deren Monoether, Amide wie Dimethylformamid, Diethylformamid, Dibutylformamid, N,N-Dimethylacetamid, niedere Alkansäuren wie Ameisensäure, Essigsäure, Propionsäure oder Basen, wie voranstehend genannt, und Mischungen dieser Lösungsmittel mit Wasser in Frage. Die Umsetzungstemperaturen liegen zwischen 50 und 300°C, vorzugsweise bei 50 bis 150°C, wenn in Lösung gearbeitet wird.

10

15 Die neuen 7-Amino-triazolo[1,5-a]-pyrimidine werden gegebenenfalls nach Verdampfen des Lösungsmittels oder Verdünnen mit Wasser als kristalline Verbindungen isoliert.

20 Die für die Herstellung der 7-Amino-azolo[1,5-a]-pyrimidine benötigten substituierten Alkylcyanide der Formel VI sind teilweise bekannt oder können nach bekannten Methoden aus Alkylcyaniden und Carbonsäureestern mit starken Basen, z.B. Alkalihydriden, Alkaliamiden oder Metallalkylen, hergestellt werden (vgl.: J. Amer. Chem. Soc. Bd. 73, (1951) S. 3766).

25 Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

30 Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht-, Säure- oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schadpilz erfolgen.

35 Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

40 Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod, insbesondere Fluor oder Chlor;

Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen, z.B. C₁-C₆-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Tri-methylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 2, 4 oder 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können: insbesondere C₁-C₂-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlor-methyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl oder 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;

Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger Position, z.B. C₂-C₆-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-but-enyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-but enyl, 1,1-Dimethyl-3-but enyl, 1,2-Dimethyl-1-but enyl, 1,2-Dimethyl-2-but enyl, 1,2-Dimethyl-3-but enyl, 1,3-Dimethyl-1-but enyl, 1,3-Dimethyl-2-but enyl, 1,3-Dimethyl-3-but enyl, 2,2-Dimethyl-3-but enyl, 2,3-Dimethyl-1-but enyl, 2,3-Dimethyl-2-but enyl, 2,3-Dimethyl-3-but enyl, 3,3-Dimethyl-1-but enyl, 3,3-Dimethyl-2-but enyl, 1-Ethyl-1-but enyl, 1-Ethyl-2-but enyl, 1-Ethyl-3-but enyl, 2-Ethyl-1-but enyl, 2-Ethyl-2-but enyl, 2-Ethyl-3-but enyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

Halogenalkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger Positi-

on (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

5 Alkinyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Dreifachbindungen in beliebiger Position, z.B. C₂-C₆-Alkinyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

5 Cycloalkyl: mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6 Kohlenstoffringgliedern, wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl;

20 In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)- und (S)-Isomere und die Razemate von Verbindungen der Formel I eingeschlossen, die chirale Zentren aufweisen.

25 Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Triazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

Verbindungen I werden bevorzugt, in denen die Gruppe R¹ maximal 9 Kohlenstoffatome aufweist.

30 Gleichermaßen werden Verbindungen der Formel I bevorzugt, in denen R¹ eine unverzweigte oder ein- oder zweifach verzweigte Halogenalkylgruppe darstellt.

35 In einer Ausgestaltung der erfindungsgemäßen Verbindungen I steht R¹ für C₁-C₁₄-Halogenalkyl, C₁-C₁₂-Halogenalkoxy-C₁-C₁₂-alkyl, C₁-C₁₂-Alkoxy-C₁-C₁₂-halogenalkyl, C₂-C₁₂-Halogenalkenyl oder C₂-C₁₂-Halogenalkinyl, welche Gruppen ein oder zwei Halogenatome aufweisen.

40 Daneben werden Verbindungen der Formel I bevorzugt, in denen R¹ für eine Gruppe (CH₂)_nCF₃ oder CH(CH₃)(CH₂)_mCF₃, worin n eine Zahl von 0 bis 13 und m eine Zahl von 0 bis 11 bedeutet, steht.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R¹ für Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-di-

5 fluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl, 1,1,1-Trifluorprop-2-yl, 1-Chlorpropyl, 1-Fluorpropyl, 3-Chlorpropyl, 3-Fluorpropyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, 1-Chlorbutyl, 1-Fluorbutyl, 4-Chlorbutyl, 4-Fluorbutyl, 4,4,4-Trifluorbutyl, 1-Chlorpentyl, 1-Fluorpentyl, 5,5,5-Trifluorpentyl, 5-Chlorpentyl, 5-Fluorpentyl, 1-Chlorhexyl, 1-Fluorhexyl, 6-Chlorhexyl, 6-Fluorhexyl, 6,6,6-Trifluorhexyl, 1-Chlorheptyl, 10 1-Fluorheptyl, 7-Chlorheptyl, 7-Fluorheptyl, 7,7,7-Trifluorheptyl, 1-Chloroctyl, 1-Fluoroctyl, 8-Fluoroctyl, 8,8,8-Trifluoroctyl, 1-Chlornonyl, 1-Fluornonyl, 9-Fluornonyl, 9,9,9-Trifluornonyl, 9-Chlornonyl, 1-Fluordecyl, 1-Chlordecyl, 10-Fluordecyl, 10,10,10-Trifluordecyl, 10-Chlordecyl, 1-Chlorundecyl, 1-Fluorundecyl, 11-Chlorundecyl, 11-Fluorundecyl, 11,11,11-Trifluorundecyl, 1-Chlordodecyl, 1-Fluordodecyl, 12-Chlordodecyl, 12-Fluordodecyl oder 12,12,12-Trifluordodecyl steht.

In einer bevorzugten Ausführung der Verbindungen der Formel I liegt keine Gruppe R^a vor.

20 Verbindungen I sind besonders bevorzugt, in denen Kohlenstoffketten von R¹ und R² gemeinsam nicht mehr als 14 Kohlenstoffatome aufweisen.

In einer Ausgestaltung der erfindungsgemäßen Verbindungen I steht R² für Methyl, Ethyl, iso-Propyl, n-Propyl oder n-Butyl, insbesondere Methyl.

25 In einer weiteren bevorzugten Ausführung der Verbindungen der Formel I liegt keine Gruppe R^b vor.

30 Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

35 Tabelle 1
Verbindungen der Formel I, in denen R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht und R² Methyl bedeutet

Tabelle 2

40 Verbindungen der Formel I, in denen R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht und R² Ethyl bedeutet

Tabelle 3

Verbindungen der Formel I, in denen R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht und R² n-Propyl bedeutet

5 Tabelle 4

Verbindungen der Formel I, in denen R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht und R² iso-Propyl bedeutet

Tabelle 5

10 Verbindungen der Formel I, in denen R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht und R² n-Butyl bedeutet

Tabelle A

Nr.	R ¹
A-1	CH ₂ F
A-2	CH ₂ Cl
A-3	CHF ₂
A-4	CHCl ₂
A-5	CF ₃
A-6	CCl ₃
A-7	CHFCH ₃
A-8	CHClCH ₃
A-9	CH ₂ CH ₂ F
A-10	CH ₂ CH ₂ Cl
A-11	CCl ₂ CH ₃
A-12	CF ₂ CH ₃
A-13	CH ₂ CHF ₂
A-14	CH ₂ CHCl ₂
A-15	CH ₂ CF ₃
A-16	CH ₂ CCl ₃
A-17	CF ₂ CF ₃
A-18	CCl ₂ CCl ₃
A-19	CHFCH ₂ CH ₃
A-20	CHClCH ₂ CH ₃
A-21	CH ₂ CHFCH ₃

Nr.	R ¹
A-22	CH ₂ CHClCH ₃
A-23	CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
A-24	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
A-25	CCl ₂ CH ₂ CH ₃
A-26	CF ₂ CH ₂ CH ₃
A-27	CH ₂ CH ₂ CHF ₂
A-28	CH ₂ CH ₂ CHCl ₂
A-29	CH ₂ CH ₂ CF ₃
A-30	CH ₂ CH ₂ CCl ₃
A-31	CF ₂ CF ₂ CF ₃
A-32	CCl ₂ CCl ₂ CCl ₃
A-33	CH(CH ₃)CF ₃
A-34	CH(CH ₃)CH ₂ F
A-35	CH(CH ₃)CH ₂ Cl
A-36	CH(CH ₃)CHF ₂
A-37	CH(CH ₃)CHCl ₂
A-38	CH(CH ₂ F) ₂
A-39	CH(CH ₂ Cl) ₂
A-40	CH(CHF ₂) ₂
A-41	CH(CHCl ₂) ₂
A-42	CHFCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-43	CHClCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-44	CH ₂ CHFCH ₂ CH ₃
A-45	CH ₂ CHClCH ₂ CH ₃
A-46	CH ₂ CH ₂ CHFCH ₃
A-47	CH ₂ CH ₂ CHClCH ₃
A-48	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
A-49	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
A-50	CCl ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-51	CF ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-52	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHF ₂
A-53	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHCl ₂

Nr.	R ¹
A-54	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃
A-55	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CCl ₃
A-56	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃
A-57	CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₃
A-58	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ F
A-59	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Cl
A-60	CH(CH ₃)CH ₂ CF ₃
A-61	CHFCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-62	CHClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-63	CH ₂ CHFCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-64	CH ₂ CHClCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-65	CH ₂ CH ₂ CHFCH ₂ CH ₃
A-66	CH ₂ CH ₂ CHClCH ₂ CH ₃
A-67	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHFCH ₃
A-68	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHClCH ₃
A-69	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
A-70	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
A-71	CCl ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-72	CF ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-73	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHF ₂
A-74	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHCl ₂
A-75	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃
A-76	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CCl ₃
A-77	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃
A-78	CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₂ CCl ₃
A-79	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
A-80	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
A-81	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CF ₃
A-82	CHFCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-83	CHClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-84	CH ₂ CHFCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-85	CH ₂ CHClCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃

Nr.	R ¹
A-182	CH ₂ CHFCH ₂ CH ₃
A-183	CH ₂ CHCICH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-184	CH ₂ CH ₂ CHFCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-185	CH ₂ CH ₂ CHCICH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-186	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHFCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-187	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHCICH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-188	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHFCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-189	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHCICH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-190	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHFCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-191	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHCICH ₂ CH ₂ CH ₃
A-192	CH ₂ CHFCH ₂ CH ₃
A-193	CH ₂ CHCICH ₂ CH ₃
A-194	CH ₂ CHFCH ₃
A-195	CH ₂ CHCICH ₃
A-196	CH ₂ F
A-197	CH ₂ Cl
A-198	CCl ₂ CH ₃
A-199	CF ₂ CH ₃
A-200	CH ₂ F
A-201	CH ₂ CHCl ₂
A-202	CH ₂ CF ₃
A-203	CH ₂ CCl ₃
A-204	CF ₂ CF ₃
A-205	CCl ₂ CCl ₃
A-206	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ F
A-207	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Cl
A-208	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃
A-209	CH=CH ₂
A-210	CH ₂ CH=CH ₂
A-211	CH=CHCH ₃
A-212	C(CH ₃)=CH ₂
A-213	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂

Nr.	R ¹
A-278	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₃
A-279	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-280	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH(CH ₃) ₂
A-281	C≡CH
A-282	CH ₂ C≡CH
A-283	C≡CCH ₃
A-284	CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-285	CH ₂ C≡CCH ₃
A-286	C≡CCH ₂ CH ₃
A-287	CH(CH ₃)C≡CH
A-288	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-289	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-290	CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-291	C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-292	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CH
A-293	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-294	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-295	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-296	CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-297	C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-298	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-299	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₃
A-300	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-301	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-302	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-303	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-304	CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-305	C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-306	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-307	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-308	CH(CH ₃)CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-309	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH

Nr.	R ¹
A-310	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-311	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-312	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-313	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-314	CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-315	C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-316	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-317	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-318	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-319	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-320	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-321	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-322	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-323	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-324	CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-325	C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-326	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-327	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-328	CH ₂ C≡CH
A-329	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃
A-330	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃
A-331	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-332	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-333	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-334	CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-335	CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-336	C≡CCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-337	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH
A-338	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CCH ₃

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Oomyceten* und *Basidiomyceten*,

insbesondere aus der Klasse der *Oomyceten*. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an ver-

5 schiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

10 Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
- *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
- *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- *Plasmopara viticola* an Reben,

20

- *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,

- *Puccinia*-Arten an Getreide,
- *Pyricularia oryzae* an Reis,

25

- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- *Uncinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

30

Insbesondere eignen sie sich zur Bekämpfung von Schadpilzen aus der Klasse der *Oomyceten*, wie *Phytophthora infestans*, *Plasmopara viticola* und *Pseudoperonospora*-Arten.

35

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Paecilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

20

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

5

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

10

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 1 bis 1000 g/100 kg, vorzugsweise 5 bis 100 g/100 kg Saatgut benötigt.

15

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Qubikmeter behandelten Materials.

20

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

25

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln. Als Lösungsmittel / Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht:

30

- Wasser, aromatische Lösungsmittel (z.B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalkohol), Ketone (z.B. Cyclohexanon, gamma-Butyrolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP), Acetate (Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,

35

- Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutylnaphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykolether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Tristerylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfatablaugen und Methylcellulose in Betracht.

5

5

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutylnaphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykolether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Tristerylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfatablaugen und Methylcellulose in Betracht.

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

10

<p

wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt. Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff.

B Dispergierbare Konzentrate (DC)

5 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Cyclohexanon unter Zusatz eines Dispergiermittels z.B. Polyvinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Dispersion.

C Emulgierbare Konzentrate (EC)

10 15 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

D Emulsionen (EW, EO)

15 40 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Diese Mischung wird mittels einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebbracht und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

20

E Suspensionen (SC, OD)

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs.

25

F Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)

30 50 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z.B. Extrusion, Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

G Wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)

35 75 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

2. Produkte für die Direktapplikation

H Stäube (DP)

5 Gew. Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95 % feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubemittel.

I Granulate (GR, FG, GG, MG)

10 0.5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95.5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation.

J ULV- Lösungen (UL)

15 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einem organischen Lösungsmittel z.B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikation.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

20 25 Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

30 35 Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

40 Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Netzmittel, Adjuvants, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

- Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
- Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph
- Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyprodinil,
- Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin,
- Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenoconazole, Dinitroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Flutriafol, Hexaconazol, Imazalil, Ipconazol, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Simeconazol, Tebuconazol, Tetraconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
- Dicarboximide wie Iprodion, Myclozolin, Procymidone, Vinclozolin,
- Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
- Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon, Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, KIF 230, Mepronil, Nuarimol, Picobenzamid, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquilon, Quinoxyfen, Silthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,
- Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
- Nitrophenylderivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl
- Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,

- Schwefel
- Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthiavalicarb, Carpropamid, Chlothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Diclomezin, Dicloctemet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Aacetat, Fenoxanil, Ferimzone, Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, NF 149, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid,
- Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
- Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid
- Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.

Synthesevorschriften

5 Anhand der nachstehenden Synthesevorschriften können unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen die Verbindungen I erhalten werden.

Vorschrift 1: Herstellung der Acylcyaniden der Formel VI

20 Eine Lösung von 0,45 mol eines Alkylnitrils in 300 ml Tetrahydrofuran (THF) wird bei –70°C mit einer Lösung von 0,495 mol Butyllithium in Hexan versetzt, dann etwa drei Std. bei dieser Temperatur gerührt und mit 0,45 mol Alkylcarbonsäureethylester versetzt. Anschließend wird noch etwa 16 Std. bei 20 – 25°C gerührt, dann 200 ml Wasser zugesetzt und mit verd. HCl-Lösung angesäuert. Nach Phasentrennung wird die organische Phase abgetrennt, mit Wasser gewaschen, getrocknet und vom Lösungsmittel befreit. Das Acylcyanid der Formel VI bleibt als Rückstand zurück.

Vorschrift 2: Herstellung der 5,6-Dialkyl-7-amino-triazolopyrimidine der Formel I

30 Eine Mischung von je 1,27 mol Acylcyanid aus Beispiel 1, 3-Amino-1,2,4-triazol und 0,25 mol p-Toluolsulfonsäure in 900 ml Mesitylen wird etwa 4 Std. auf 170°C erhitzt. Nach Abkühlen auf etwa 20 - 25°C wird der Niederschlag abfiltriert, dann in Dichlormethan aufgenommen. Aus der Lösung wird nach Waschen mit Wasser und Trocknen das Lösungsmittel abdestilliert, als Rückstand bleibt das Triazolopxrimidin zurück.

35 Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I lässt sich durch die folgenden Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe werden als 10%ige Emulsion in einem Gemisch aus 70 Gew.-% Cyclohexanon, 20 Gew.-% Nekanil® LN (Lutensol® AP6, Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) und 10 Gew.-% Wettol® EM (nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Ricinusöl) aufbereitet

5 und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen Rebenperonospora verursacht durch *Plasmopara viticola*

10 Blätter von Topfreben werden mit wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag werden die Unterseiten der Blätter mit einer wässrigen Sporangienaufschwemmung von *Plasmopara viticola* inokuliert. Danach werden die Reben zunächst für 48 Stunden in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei 24°C und anschließend für 5 Tage im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 30°C aufgestellt. Nach dieser Zeit werden die Pflanzen zur Beschleunigung des Sporangienträgerausbruchs abermals für 16 Stunden in eine feuchte Kammer gestellt. Dann wird das Ausmaß der Befallsentwicklung auf den Blattunterseiten visuell ermittelt.

20 Anwendungsbeispiel 2: Aktivität gegen die Krautfäule an Tomaten verursacht durch *Phytophthora infestans* bei protektiver Behandlung

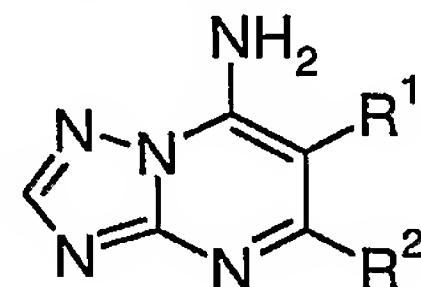
25 Blätter von getopften Tomatenpflanzen werden mit einer wässriger Suspension der Wirkstoffe bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag werden die Blätter mit einer wässrigen Sporangienaufschwemmung von *Phytophthora infestans* infiziert. Anschließend werden die Pflanzen in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 18 und 20°C aufgestellt. Nach 6 Tagen wird der Befall visuell in % ermittelt.

5,6-Dialkyl-7-amino-triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

Zusammenfassung

5

5,6-Dialkyl-7-amino-triazolopyrimidine der Formel I



I

in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

10 R¹ Halogenalkyl, Halogenalkoxyalkyl, Alkoxyhalogenalkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Alkinyl oder Halogenalkinyl;

15 R² Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl;

15 wobei R¹ und/oder R² gemäß der Beschreibung substituiert sein können;

Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.